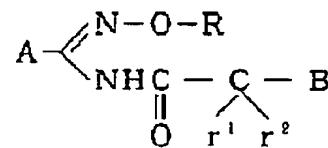


EUROPEAN PATENT OFFICE

Patent Abstracts of Japan

PUBLICATION NUMBER : 10095771
 PUBLICATION DATE : 14-04-98



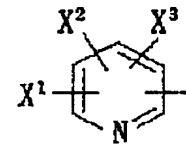
I

APPLICATION DATE : 19-09-96
 APPLICATION NUMBER : 08269308

APPLICANT : NIPPON SODA CO LTD;

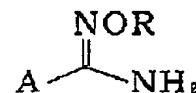
INVENTOR : YAMANAKA HOMARE;

INT.CL. : C07D213/78 A01N 43/08 A01N 43/10
 A01N 43/40 A01N 43/54 A01N 43/56
 A01N 43/78 C07D231/14 C07D239/28
 C07D277/30

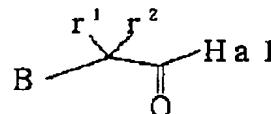


II

TITLE : AMIDOXIME DERIVATIVE, ITS
 PRODUCTION AND AGRICULTURAL
 AND HORTICULTURAL GERMICIDE



III



IV

ABSTRACT : PROBLEM TO BE SOLVED: To produce the subject compound, which can industrially and advantageously be synthesized and provide a safely usable agricultural and horticultural germicide capable of producing sure effects.

SOLUTION: This compound is represented by formula I (A is a heterocyclic group represented by formula II (X¹ to X³ are each H, a halogen, a C₁₋₄ alkyl, etc.), etc.; R is a (substituted)C₁₋₄ alkyl, a (substituted)C₂₋₄ alkenyl, etc.; B is a (substituted)phenyl or a (substituted)heterocyclic group; r¹ and r² are each H, a halogen, a C₁₋₄ alkyl, etc.], e.g. N'cyclopropylmethoxy-N-phenylacetyl-4-trifluoromethylpyridine-3carboxamidine. Furthermore, the compound is preferably obtained by reacting a compound represented by formula III with a compound represented by formula IV (Hal is a halogen), as desired, in the presence of a base such as pyridine in an organic solvent, e.g. benzene within a temperature range of 0°C to the boiling point of the solvent for 10min to several tens of hr.

COPYRIGHT: (C)1998,JPO

THIS PAGE BLANK (USPTO)

14/41491-US

= JP 10-095771

98-280395/25 C02

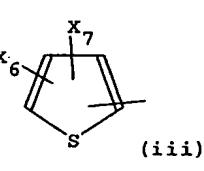
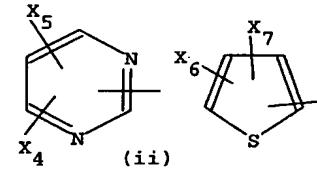
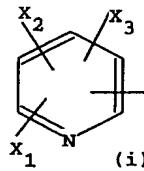
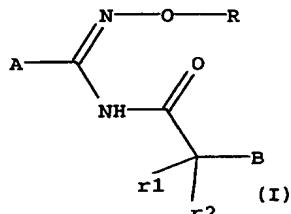
NIPS 96.09.19

*JP 10095771-A

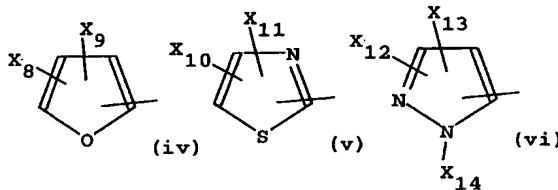
NIPPON SODA CO
 96.09.19 96JP-269308 (98.04.14) C07D 213/78, A01N 43/08, 43/10,
 43/40, C07D 231/14, 277/30, 333/24, 307/68, 239/28, A01N 43/54,
 43/56, 43/78

New amidoxime derivatives - useful as agricultural and horticultural bactericides
 C98-086887

Amidoxime derivatives of formula (I) are new:



JP 10095771-A+



x_1-x_{14} = H, halo, 1-4C alkyl, 1-4C haloalkyl, 1-4C alkoxy, 1-4C haloalkoxy, 1-4C alkylthio, 1-4C alkylsulphinyl, 1-4C alkylsulphonyl, NO_2 , NH_2 or 1-4C alkylcarbonylamino;
 R = 1-4C alkyl, 2-4C alkenyl or 1-4C alkynyl (each optionally substituted);

B = phenyl or hetero ring (each optionally substituted); and
 r₁, r₂ = H, halo, 1-4C alkyl, 1-4C haloalkyl, 1-4C alkoxy, 1-4C alkylthio or NH_2 ; or

Cr_1r_2 complete carbonyl.

USE

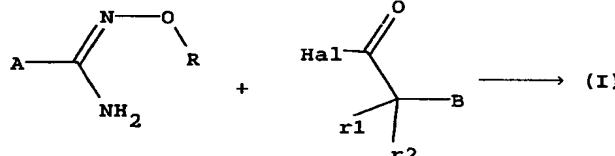
(I) are useful as agricultural and horticultural bactericides.

ADVANTAGES

(I) can be industrially synthesised on a large scale and the resulting agricultural, horticultural bactericides are safe and effective.

PREPARATION

E.g:



Hal = halo.

JP 10095771-A+1

98-280395/25

EXAMPLE

0.4 g N'-cyclopropyl-methoxy-4-trifluoromethyl-pyridin-3-carboxamidine was dissolved in 5 ml toluene and 0.29 g phenylacetyl chloride was added at room temperature. The mixture was heated for 4 hours with stirring under reflux. The reaction mixture was poured into cold water and extracted with ethyl acetate and then dried over anhydrous magnesium sulphate.

The solvent was removed by evaporation under reduced pressure and the obtained crude product was purified column chromatography (silica gel) to give 0.5 g N'-cyclopropyl-methoxy-N-phenylacetyl-4-trifluoromethyl-pyridin-3-carboxamidine.

BIOLOGICAL DATA

No data is disclosed. (LME)
 (48pp055DwgNo.0/0)

JP 10095771-A/2

THIS PAGE BLANK (USPTO)

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平10-95771

(43)公開日 平成10年(1998)4月14日

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	F I
C 07 D 213/78		C 07 D 213/78
A 01 N 43/08		A 01 N 43/08
43/10		43/10
43/40	1 0 1	43/40
43/54		43/54
	審査請求 未請求 請求項の数 4 FD (全 48 頁) 最終頁に統く	

(21)出願番号	特願平8-269308	(71)出願人 000004307 日本曹達株式会社 東京都千代田区大手町2丁目2番1号
(22)出願日	平成8年(1996)9月19日	(72)発明者 笠原 勇 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社小田原研究所内
		(72)発明者 杉浦 忠司 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社小田原研究所内
		(72)発明者 佐野 慶亮 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社小田原研究所内
		(74)代理人 弁理士 東海 裕作 最終頁に統く

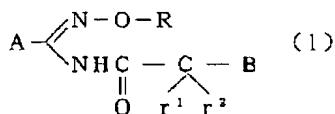
(54)【発明の名称】 アミドオキシム誘導体、その製造法及び農園芸用殺菌剤

(57)【要約】

【課題】工業的に有利に合成でき、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤となる新規化合物の提供。

【解決手段】一般式(1)

【化1】

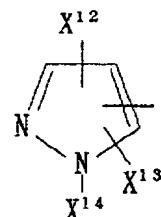
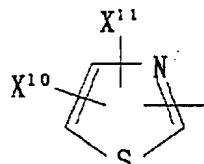
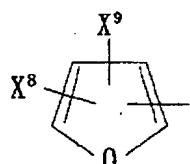
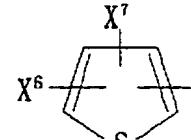
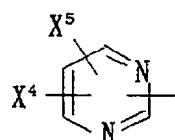
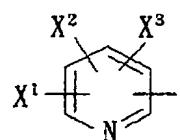
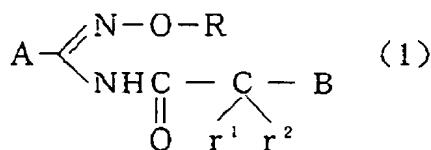


(式中、Aは置換されてもよいヘテロ環を示し、Rは置換されてもよいC₁₋₄アルキル基、置換されてもよいC₂₋₄アルケニル基または置換されてもよいC₁₋₄アルキニル基を示し、Bは置換されてもよいフェニル基または置換されてもよいヘテロ環を示し、r¹、r²は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、C₁₋₄アルキルチオ基またはアミノ基を示し、またr¹、r²は、一緒になってカルボニル基を形成してもよい。)で表されるアミドオキシム誘導体で解決できる。

【特許請求の範囲】

【請求項1】一般式(1)

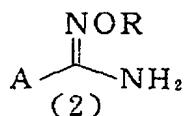
【化1】



(式中、 $\text{X}^1 \sim \text{X}^{14}$ は、互いに独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} ハロアルコキシ基、 C_{1-4} アルキルチオ基、 C_{1-4} アルキルスルフィニル基、 C_{1-4} アルキルスルホニル基、ニトロ基、アミノ基または C_{1-4} アルキルカルボニルアミノ基を表す。)で表されるヘテロ環群から選ばれる一種のヘテロ環基を表し、Rは置換されてもよい C_{1-4} アルキル基、置換されてもよい C_{2-4} アルケニル基または置換されてもよい C_{1-4} アルキニル基を示し、Bは置換されてもよいフェニル基または置換されてもよいヘテロ環を示し、 r^1 、 r^2 は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{1-4} アルキルチオ基またはアミノ基を示し、また r^1 、 r^2 は、一緒になってカルボニル基を形成してもよい。)で表されるアミドオキシム誘導体。

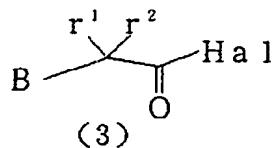
【請求項2】一般式(2)

【化3】



(式中、A、Rは前記と同じ意味を示す。)で表される化合物と、一般式(3)

【化4】

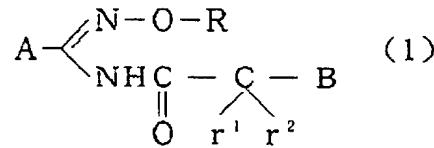


【式中、Aは、化2】

【化2】

(式中、 Hal はハロゲン原子を示し、B、 r^1 、 r^2 は前記と同じ意味を示す。)で表される化合物とを反応させることを特徴とする一般式(1)

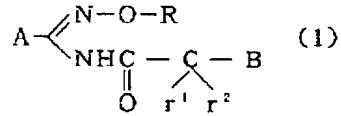
【化5】



(式中、A、R、B、 r^1 、 r^2 は前記と同じ意味を示す。)で表される化合物の製造法。

【請求項4】一般式(1)

【化6】



(式中、A、R、B、 r^1 、 r^2 は前記と同じ意味を示す。)で表されるアミドオキシム誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農園用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、新規なアミドオキシム誘導体、その製造法及び農園芸用殺菌剤に関する。

【0002】

【従来の技術】従来より、農園芸作物の栽培に当り、作物の病害に対して多数の防除薬剤が使用されているが、その防除効力が不十分であったり、薬剤耐性の病原菌の出現によりその使用が制限されたり、また植物体に薬害

や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類に対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の出現が強く要請されている。

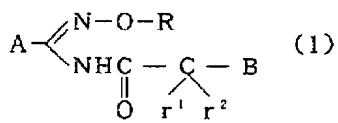
【0003】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、工業的に有利に合成でき効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤となりうる新規化合物を提供することにある。

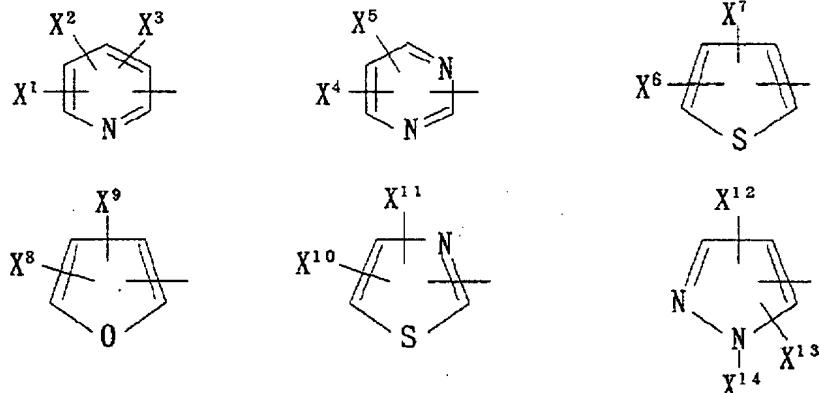
【0004】

【課題を解決するための手段】すなわち、本発明は、一般式(1)

【化7】



(式中、Aは置換されてもよいヘテロ環を示し、Rは置



【0007】Aの置換基であるX¹～X¹⁴はハロゲン原子として、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素などを例示することができ、X¹～X¹⁴はC₁₋₄アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基などを例示することができ、X¹～X¹⁴はC₁₋₄ハロアルキル基としては、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ジフロロメチル基、トリフルオロメチル基、プロモメチル基、ジブロモメチル基、クロロエチル基、フロロエチル基、ジクロロエチル基、ジフロロエチル基、トリフルオロエチル基、テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、クロロプロピル基、フロロプロピル基、バーフロロプロピル基、クロロイソプロピル基、フロロイソプロピル基、バーフロロイソプロピル基、クロロブチル基、フロロブチル基、バーフロロブチル基、クロロイソブチル基、フロロイソブチル基、バーフロロイソブチル基、クロロ-s-ブチル基、フロロ-s-ブチル基、バーフロロ-s-ブチル基、クロロ-t-ブチル基、フロロ-t-ブチル基、バーフロロ-t-ブチル基などの直鎖もしくは分枝のC₁₋₄ハロアルキル

換されてもよいC₁₋₄アルキル基、置換されてもよいC₂₋₄アルケニル基または置換されてもよいC₂₋₄アルキニル基を示し、Bは置換されてもよいフェニル基または置換されてもよいヘテロ環を示し、r¹、r²は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、C₁₋₄アルキルチオ基またはアミノ基を示し、またr¹、r²は、一緒になってカルボニル基を形成してもよい。)で表されるアミドオキシム誘導体、その製造法及び農園芸用殺菌剤である。

【0005】

【発明の実施の形態】本発明において、Aの置換されてもよいヘテロ環基のヘテロ環としては、次式のようなピリジン環、フラン環、チオフェン環、ピリミジン環、チアゾール環、ピラゾール環を例示することができる。

【0006】

【化8】

基などを例示することができ、X¹～X¹⁴はC₁₋₄アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基などを例示することができ。X¹～X¹⁴はC₁₋₄アルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、t-ブチルチオ基などを例示することができ。さらに、X¹～X¹⁴はC₁₋₄ハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、テトラフルオロエトキシ基などを例示することができ。そして水素原子である。

【0008】本発明において、Rの置換されてもよいC₁₋₄アルキル基のC₁₋₄アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、s-ブチル、t-ブチル基などを例示することができ。Rの置換されてもよいC₂₋₄アルケニル基のC₂₋₄アルケニル基としては、ビニル基、1-ブロペニル基、2-ブロペニル基、イソブロペニル

基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基などを例示することができる。Rの置換されてもよいC₂₋₄ アルキニル基のC₂₋₄ アルキニル基としては、エチニル基、プロパギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基などを例示することができる。

【0009】また、Rの置換されてもよいC₁₋₄ アルキル基、置換されてもよいC₂₋₄ アルケニル基、置換されてもよいC₂₋₄ アルキニル基において、C₁₋₄ アルキル基、C₂₋₄ アルケニル基およびC₂₋₄ アルキニル基を置換する基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロオクチル基、シクロヘプチル基などのC₃₋₈ のシクロアルキル基、1-フルオロシクロプロピル基、2-フルオロシクロプロピル基、1-クロロシクロプロピル基、2-クロロシクロプロピル基、2, 2-ジフルオロシクロプロピル基、2, 2-ジクロロシクロプロピル基、2-フルオロシクロペンチル基、3-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、3-クロロシクロペンチル基、3, 4-ジフルオロシクロヘキシル基、3, 4-ジクロロヘキシル基、3, 4-ジブロモシクロヘキシル基等のC₃₋₈ のハロシクロアルキル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基等のC₃₋₈ のシクロアルケニル基、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基等のC₁₋₄ アルコキオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基等のC₁₋₄ アルキル基でモノないしジ置換されてもよいアミノ基、カルバモイル基、メチルカルバモイル基、ジメカルバモイル基等のC₁₋₄ アルキル基でモノないしジ置換されてもよいカルバモイル基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピル基、イソプロピルチオ基等のC₁₋₄ アルキルチオ、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基等のC₁₋₄ アルキルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基等のC₁₋₄ アルキルスルホニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等のC₁₋₄ アルコキシカルボニル基、カルボキシ基やシアノ基等を例示することができる。

【0010】より好ましいRの例としては、置換されてもよい直鎖または分枝のC₁₋₄ アルキル基を挙げることができる。より具体的には、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基等の直鎖または分枝のC₁₋₄ アルキル基のほか、一般式R¹CH₂（ここで、R¹はC₃₋₈ のシクロアルキル基、C₁₋₃ ハロアルキル基、C₁₋₃ アルコキシ基、C₁₋₃ アルキルチオ基、C₁₋₃ アルキルスルフィニル基、C₁₋₃ アルキルスルホニル基、C₁₋₃ アルコキシカルボニル基、シアノ基、アミノ基、C₁₋₃ モノアルキルアミノ基、C₁₋₃ ジアルキルアミノ基、アシルアミノ基等を表す。）で表される基、例えば、シクロプロピル

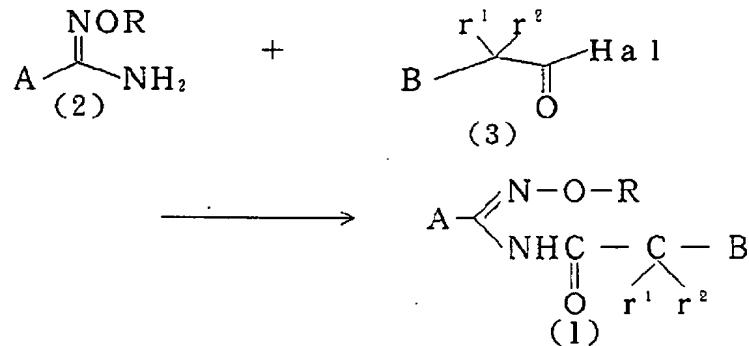
メチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基などのC₄₋₈ シクロアルキルメチル基、2-フルオロシクロプロピルメチル基、1-フルオロシクロプロピルメチル基、1, 2-ジフルオロシクロプロピルメチル基、3, 4-ジブロモシクロヘキシル基などのC₄₋₈ ハロシクロアルキルメチル基、2-クロロエチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジクロロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2-トリフルオロエチルなどのC₁₋₄ ハロアルキル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基などのC₁₋₄ アルコキシメチル基、プロパルギル基などのC₂₋₄ アルキニル基、アリル基、2-ブチニル基などのC₂₋₄ アルケニル基、メトキシカルボニルカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基などのアルコキシカルボニルメチル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基などのアルキルチオメチル基、メチルスルフィニルメチル基、エチルスルフィニルメチル基などのアルキルスルフィニルメチル基、メチルスルホニルメチル基、エチルスルホニルメチル基などのアルキルスルホニルメチル基、アミノメチル基、N-メチルアミノメチル基、N, N-ジメチルアミノメチル基、N-アセチルアミノメチル基、N-ベンゾイルアミノメチル基などの置換アミノメチル基、シアノメチル基等を例示することができる。

【0011】Bの置換されてもよいヘテロ環基のヘテロ環としては、ピリジン環、フラン環、チオフェン環、ピラゾール環、イミダゾール環、トリアゾール環、ピロール環、ピラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、オキサゾール環、イソオキサゾール環またはチアゾール環などのN, O, S等のヘテロ原子を1~4個含む5~6員の芳香族ヘテロ環を例示することができる。

【0012】Bのフェニル基およびヘテロ環基の置換基は、ベンゼン環あるいはヘテロ環の任意の位置に、1または2個以上置換していてもよく、2個以上置換しているときは、それらは相異なっていてもよい。好ましい置換基として、例えば、フッ素、塩素、臭素などのハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、t-ブチルなどのC₁₋₄ アルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシなどのC₁₋₄ アルコキシ基、アリルオキシ、クロチルオキシなどのC₂₋₄ アルケニルオキシ基、プロパギルオキシなどのC₂₋₄ アルキニルオキシ基、クロロメチル、フロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリブロモメチルなどのC₁₋₄ ハロアルキル基、クロロメトキシ、フロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリブロモエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシなどのC₁₋₄ ハロアルコキシ基等を挙げ

ことができる。

【0013】 r^1 および r^2 として、同一または相異なって、水素原子、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、t-ブチルなどのC₁₋₄ アルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシなどのC₁₋₄ アルコキシ基、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、t-ブチルチオなどのC₁₋₄ アルキルチオ基、クロロメチル、フロロメチル、トリフロ



【0016】(式中、Halはハロゲン原子を示し、A, R, B, r^1 および r^2 は前記と同じ意味を示す。)

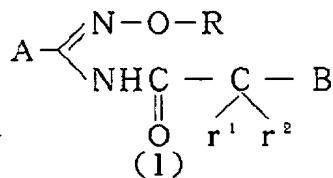
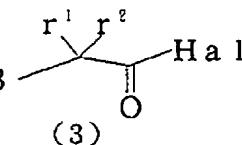
反応は(2)と化合物(3)を有機溶媒中、所望により、塩基の存在下、0°Cから用いられる溶媒の沸点までの温度範囲で、10分から数10時間反応させることによって行われる。ここで用いることができる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、THF、ジエチルエーテル等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、DMFなどのアミド類、DMSO、アセトニトリル等、あるいはこ

オロメチル、トリクロロメチル、トリブロモメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチルなどのC₁₋₄ ハロアルキル基およびアミノ基を例示することができる。さらに、 r^1 および r^2 は一緒になってカルボニル基を形成してもよい。

【0014】本発明化合物は次の方法によって製造することができる。

【0015】

【化9】

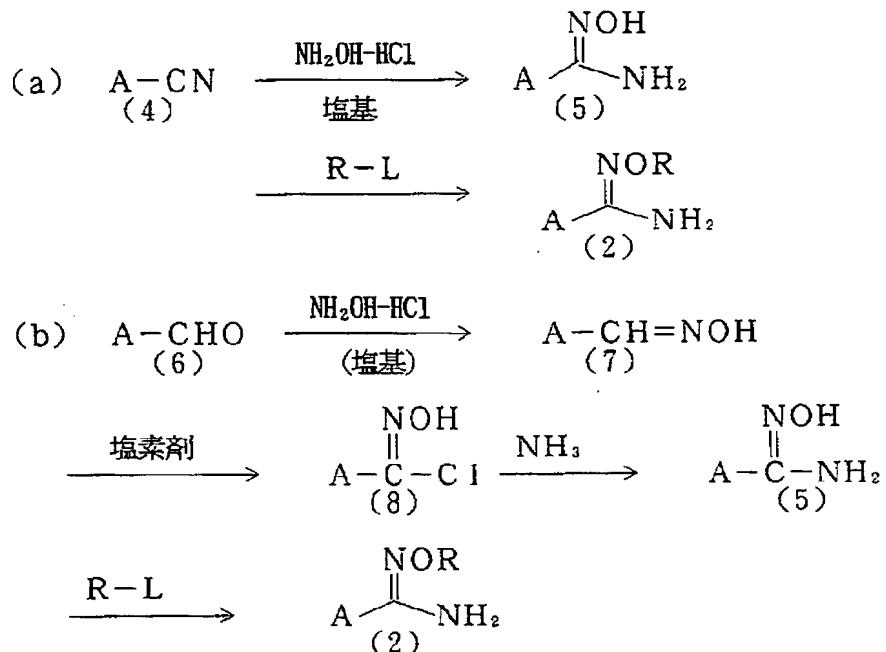


これらの混合物が挙げられる。塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、DBU、水素化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等があげられる。反応終了後は通常の後処理を行い、シリカゲルカラムクロマトグラフィー等にて精製することにより目的物を得ることができる。

【0017】また、本発明の原料化合物(2)は、例えば、以下の方法で合成することができる。

【0018】

【化10】



【0019】(式中、Lはパラトルエンスルホニルオキシ基、メチルスルホニルオキシ基、ハロゲン原子などの脱離基を表し、A、Rは前記と同じ意味を示す。)。

(a) の一段階目の反応は、不活性溶媒中、ニトリル化合物(4)と塩酸ヒドロキシルアミンとを、塩基存在下、0°Cから用いられる溶媒の沸点までの温度範囲で10分から数10時間反応させることにより、アミドオキシム化合物(5)を得るものである。反応に用いられる溶媒としては、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、THF、ジエチルエーテル等のエーテル類、DMF等のアミド類、DMSO、水等あるいはこれらの混合物が挙げられる。また、反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、トリエチルアミン、ピリジン等を例示することができる。次の反応は、溶媒中、塩基存在下、化合物(5)とR-Lで表される化合物とを、-15°Cから用いられる溶媒の沸点までの温度範囲で10分から数10時間反応させることにより、原料化合物(2)を得る。用いることのできる塩基としては、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、トリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基を例示することができる。また、溶媒および塩基によっては、所望により、クラウンエーテル類、4級アンモ

ニウム塩、ホスホニウム塩等の触媒を用いることができる。

【0020】(b) の1段階目の反応は、必要により塩基の存在下、(a) の化合物(4)から化合物(5)の反応と同様にして化合物(7)を得る。次いで化合物(7)から化合物(8)の反応は、溶媒中、氷冷下、N-クロロロコハク酸イミド、塩素等の塩素化剤を反応させる。化合物(8)から化合物(9)の反応は、溶媒中、室温付近の温度で、アンモニアもしくはアンモニア水を反応させて、化合物(5)を得る。化合物(5)から原料化合物(2)への反応は(a)の場合と同様である。塩基、溶媒などは(a)の方法のものが適宜選択して用いられる。本発明化合物の構造は、IR、NMR、MASS等から決定した。

【0021】

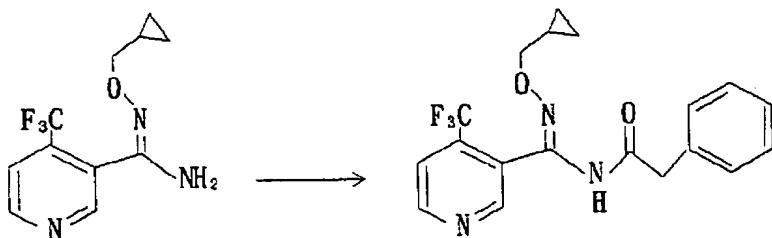
【実施例】次に実施例を挙げ、本発明を更に詳しく説明するが、本発明はこれにより何ら限定されるものでない。

【0022】実施例

N'-シクロプロピルメチルオキシ-N-フェニルアセチル-4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボキサミジンの合成

【0023】

【化11】



【0024】N' - シクロプロピルメチルオキシ - 4 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - カルボキサミジン。4 g をトルエン 5 ml に溶かし、室温で塩化フェニルアセチル 0.29 g を滴下した。これを攪拌下約4時間加熱還流した。反応終了後、反応液を冷水に注ぎ、これを酢酸エチルにて抽出し、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより分離精製して、目的物 0.50 g を得た。融点 85 - 87°C。

【0025】実施例と同様にして製造される本発明化合物を第1表に示す。なお、第1表中、A, R, B, r¹ および r² は前記一般式 (1) で表される化合物中の

A, R, B, r¹ および r² に対応する。また、X¹ ~ X¹⁴ は A の置換されてもよいヘテロ環の記載の置換基に対応する。また、第1表中、A欄のヘテロ環については、次のような略記を行った。3-pyrid(3-pyridyl), 4-pyrid(4-pyridyl), 2-pyrid(2-pyridyl), 5-pyrim(pyrimidin-5-yl), 4-pyrim(pyrimidin-4-yl), 3-thien(3-thienyl), 2-thien(2-thienyl), 3-furyl, 2-furyl, 4-thiaz(thiazol-4-yl), 5-thiaz(thiazol-5-yl), 4-pyraz(pyrazol-4-yl), 3-pyraz(pyrazol-3-yl)。また、X¹ ~ X¹⁴ において、それぞれ水素原子である場合は表示を省略した。

【0026】

【表1001】

第1表 (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
1	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	85-87 °C
2	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	99-100°C
3	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
4	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
5	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
6	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
7	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
8	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-F	97-98 °C
9	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
10	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
11	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
12	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
13	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
14	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
15	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Bt	
16	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	
17	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe	
18	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe -5-Me	
19	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl	
20	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Br	
21	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl-4-F	
22	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Br-4-Me	

(注) CH₂cPrは、シクロプロピルメチル基を示す(以下の表にて同じ)。

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
23	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Et	
24	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OEt	
25	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4- ¹ Pr	
26	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
27	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ C≡CH	
28	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-CF ₃	
29	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₃	
30	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₂ CF ₂ H	
31	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₃	
32	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ H	
33	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₃	
34	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₂ H	
35	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-thienyl	91-93 °C
36	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-thienyl	
37	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl- 2-thienyl	
38	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl- 2-thienyl	
39	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	5-methyl- 2-thienyl	
40	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl- 3-thienyl	
41	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	5-methyl- 3-thienyl	
42	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	pyrazol-1-yl	
43	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl- pyrazol-1-yl	
44	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl- pyrazol-1-yl	

【0028】

【表1003】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _d
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
45	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
46	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
47	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
48	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
49	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
50	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
51	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
52	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
53	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
54	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
55	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
56	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
57	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-thiazolyl	
58	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-chloro-2-thiazolyl	
59	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	4-thiazolyl	
60	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	1-pyrazinyl	
61	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-1-pyrazinyl	
62	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-pyridazinyl	
63	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-4-pyridazinyl	
64	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	2-furyl	
65	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	3-bromo-2-furyl	
66	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ cPr	triazolyl	

【0029】

【表1004】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
67	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph	
68	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
69	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
70	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
71	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
72	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
73	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
74	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-F	
75	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
76	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
77	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
78	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
79	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
80	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
81	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Et	
82	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	
83	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-C1-4-OMe	
84	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-C1-4-OMe -5-Me	
85	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-C1	
86	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Br	
87	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-C1-4-F	
88	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-2-Br-4-Me	

【0030】

【表1005】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ⁴			
89	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Et	
90	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OEt	
91	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-iPr	
92	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
93	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ C≡CH	
94	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-3-CF ₃	
95	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₃	
96	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₂ CF ₂ H	
97	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₃	
98	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ H	
99	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₃	
100	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₂ H	
101	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-thienyl	
102	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-thienyl	
103	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-methyl-2-thienyl	
104	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	4-methyl-2-thienyl	
105	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	5-methyl-2-thienyl	
106	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	4-methyl-3-thienyl	
107	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	5-methyl-3-thienyl	
108	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	pyrazol-1-yl	
109	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-methyl-pyrazol-1-yl	
110	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	4-methyl-pyrazol-1-yl	

【0031】

【表1006】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
111	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
112	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
113	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
114	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
115	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
116	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
117	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
118	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
119	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
120	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
121	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
122	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
123	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-thiazolyl	
124	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-chloro-2-thiazolyl	
125	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	4-thiazolyl	
126	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	1-pyrazinyl	
127	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-methyl-1-pyrazinyl	
128	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-pyridazinyl	
129	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-methyl-4-pyridazinyl	
130	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	2-furyl	
131	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	3-bromo-2-furyl	
132	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	triazolyl	

【0032】

【表1007】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 M. p. or n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
133	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
134	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
135	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
136	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
137	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
138	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
139	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
140	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-F	
141	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
142	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
143	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
144	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
145	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
146	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
147	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Et	
148	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	
149	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe	
150	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe -5-Me	
151	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl	
152	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Br	
153	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl-4-F	
154	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Br-4-Me	

【0033】

【表1008】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
155	4-pyrid	2,3-C1 ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
156	4-pyrid	2,3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
157	4-pyrid	3-C1-2-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
158	4-pyrid	3-F-2-C1-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
159	4-pyrid	2,5-C1 ₂ -3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
160	4-pyrid	2,5-F ₂ -3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
161	4-pyrid	2-C1-5-F-3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
162	4-pyrid	2-F-5-C1-3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
163	4-pyrid	2,3-C1 ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
164	4-pyrid	2,3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
165	4-pyrid	3-C1-2-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
166	4-pyrid	3-F-2-C1-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
167	4-pyrid	2,5-C1 ₂ -3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
168	4-pyrid	2,5-F ₂ -3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
169	4-pyrid	2-C1-5-F-3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
170	4-pyrid	2-F-5-C1-3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₃	
171	4-pyrid	2,3-C1 ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CH ₃	
172	4-pyrid	2,3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CH ₃	
173	4-pyrid	3-C1-2-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CH ₃	
174	4-pyrid	3-F-2-C1-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CH ₃	
175	4-pyrid	2,3-C1 ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
176	4-pyrid	2,3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	

【0034】

【表1009】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	ヘテロ環	A	R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
		X ¹ ~ X ¹⁴			
177	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
178	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
179	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
180	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
181	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
182	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
183	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
184	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
185	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
186	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
187	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
188	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
189	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-thiazolyl	
190	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-chloro-2-thiazolyl	
191	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4-thiazolyl	
192	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-pyrazinyl	
193	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-1-pyrazinyl	
194	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-pyridazinyl	
195	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-4-pyridazinyl	
196	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-furyl	
197	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-bromo-2-furyl	
198	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	triazolyl	

【0035】
【表1010】【0036】
【表1011】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
221	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Bt	
222	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OBt	
223	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-iPr	
224	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
225	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ C≡CH	
226	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-CF ₃	
227	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₃	
228	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₂ CF ₂ H	
229	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₃	
230	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ H	
231	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₃	
232	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₂ H	
233	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-thienyl	
234	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-thienyl	
235	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-methyl-2-thienyl	
236	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	4-methyl-2-thienyl	
237	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	5-methyl-2-thienyl	
238	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	4-methyl-3-thienyl	
239	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	5-methyl-3-thienyl	
240	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	pyrazol-1-yl	
241	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-methyl-pyrazol-1-yl	
242	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	4-methyl-pyrazol-1-yl	

【0037】

【表1012】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
243	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
244	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
245	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
246	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
247	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
248	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
249	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
250	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
251	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
252	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
253	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
254	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
255	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-thiazolyl	
256	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-chloro-2-thiazolyl	
257	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	4-thiazolyl	
258	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	1-pyrazinyl	
259	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-methyl-1-pyrazinyl	
260	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-pyridazinyl	
261	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-methyl-4-pyridazinyl	
262	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	2-furyl	
263	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	3-bromo-2-furyl	
264	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	triazolyl	

【0038】

【表1013】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ⁴			
265	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
266	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
267	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
268	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
269	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
270	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
271	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
272	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
273	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
274	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
275	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
276	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
277	3-thien	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
278	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
279	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
280	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
281	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
282	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
283	3-furyl	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	

【0039】

【表1014】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m. p. or n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
284	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
285	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
286	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
287	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
288	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
289	4-pyraz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
290	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	73-76°C
291	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	97-99°C
292	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
293	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
294	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
295	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
296	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
297	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-F	
298	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
299	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
300	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
301	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
302	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
303	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
304	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Et	
305	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	

【0040】

【表1015】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
306	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe	
307	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe -5-Me	
308	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl	
309	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Br	
310	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl-4-F	
311	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-Br-4-Me	
312	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Et	
313	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OEt	
314	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-iPr	
315	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
316	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ C≡CH	
317	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-3-CF ₃	
318	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₃	
319	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₂ CF ₂ H	
320	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₃	
321	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ H	
323	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCP ₂ CF ₃	
324	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OCP ₂ CF ₂ H	
325	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-thienyl	
326	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-thienyl	

【0041】

【表1016】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
327	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-2-thienyl	
328	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl-2-thienyl	
323	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	5-methyl-2-thienyl	
324	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl-3-thienyl	
325	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	5-methyl-3-thienyl	
326	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	pyrazol-1-yl	
327	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-methyl-pyrazol-1-yl	
328	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4-methyl-pyrazol-1-yl	
329	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
330	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
331	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
331	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
332	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
333	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
334	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
335	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
336	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
337	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
338	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
339	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	

【0042】

【表1017】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m. p. or n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
340	2-pyrid	3-Cl-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
341	2-pyrid	3-Cl-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
342	2-pyrid	3-Cl-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-CH ₃	
343	2-pyrid	2, 3-Cl ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
344	2-pyrid	2, 3-Cl ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
345	2-pyrid	2, 3-Cl ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-CH ₃	
346	2-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
347	2-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
348	2-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-CH ₃	
349	2-pyrid	2, 3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
350	2-pyrid	2, 3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
351	2-pyrid	2, 3-F ₂ -5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-CH ₃	
352	2-pyrid	2-Cl-3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
353	2-pyrid	2-Cl-3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
354	2-pyrid	3-Cl-2-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
355	2-pyrid	3-Cl-2-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-OCH ₃	
356	2-thien	3-CH ₃	CH ₂ cPr	Ph	122-124°C
357	2-thien	3-CH ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	105-107°C
358	2-thien	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	

【0043】

【表1018】

第1表 (続き) ($r^1, r^2 = H$)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	$X^1 \sim X^{14}$			
359	3-furyl	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
360	3-furyl	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
361	3-furyl	2, 4-Me ₂	CH ₂ cPr	Ph	98-99 °C
362	3-furyl	2, 4-Me ₂	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	76-77 °C
363	3-furyl	2, 4-Me ₂	CH ₂ CH ₃	Ph-4-OMe	87-88 °C
364	4-thiaz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
365	4-thiaz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
366	4-thiaz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
367	4-thiaz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
368	5-thiaz	5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
369	5-thiaz	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
370	5-thiaz	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
371	5-thiaz	2-C1-4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	98-99°C
372	5-thiaz	2-C1-4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
373	4-pyraz	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
374	4-pyraz	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
375	4-pyraz	1-Me-3-CF ₃ -5-C1	CH ₂ cPr	Ph	138-139°C
376	4-pyraz	1-Me-3-CF ₃ -5-C1	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	128-129°C
377	4-pyraz	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
378	4-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
379	4-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
380	4-pyrid	3-F-5-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	

【0044】

【表1019】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 mp. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
381	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	75-77 °C
382	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	85-86 °C
383	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
384	5-pyrim	4-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
385	5-pyrim	4-CF ₃ 4-F	CH ₂ cPr	Ph	
386	5-pyrim	4-CF ₃ 4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
387	5-pyrim	4-CF ₃ 4-F	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
388	5-pyrim	4-CF ₃ 4-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
389	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
390	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
391	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
392	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
393	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
394	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
395	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Et	
396	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	
397	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe	
398	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe -5-Me	
399	3-pyrid	2, 4-Me ₂	CH ₂ cPr	Ph	
400	3-pyrid	2, 4-Me ₂	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	81-83°C
401	3-pyrid	2, 4-Me ₂	CH ₂ CH ₃	Ph	
402	3-pyrid	2, 4-Me ₂	CH ₂ CH ₃	Ph-4-OMe	97-98°C

【0045】

【表1020】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	ヘテロ環	A	R	B	物理恒数 m.p. or n. _D
		X ¹ ~ X ¹⁴			
403	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Et	
404	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OEt	
405	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4- ¹ Pr	
406	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
407	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCH ₂ C≡CH	
408	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-3-CF ₃	
409	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₃	
410	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-CF ₂ CF ₂ H	
411	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₃	
412	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ H	
413	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₃	
414	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OCF ₂ CF ₂ H	
415	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-thienyl	
416	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-thienyl	
417	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-methyl- 2-thienyl	
418	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	4-methyl- 2-thienyl	
419	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	5-methyl- 2-thienyl	
420	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	4-methyl- 3-thienyl	
421	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	5-methyl- 3-thienyl	
422	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	pyrazol-1-yl	
423	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-methyl- pyrazol-1-yl	
424	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	4-methyl- pyrazol-1-yl	

【0046】

【表1021】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	ヘテロ環	A	R	B	物理恒数 m.p. or n _D
		X ¹ ~ X ¹⁴			
425	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-pyrrolyl	
426	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-pyrrolyl	
427	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-pyrrolyl	
428	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-methyl-3-pyrrolyl	
429	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-imidazolyl	
430	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-imidazolyl	
431	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-oxazolyl	
432	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-oxazolyl	
433	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-isoxazolyl	
434	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-methyl-2-isoxazolyl	
435	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-pyrimidinyl	
436	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
437	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-thiazolyl	
438	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-chloro-2-thiazolyl	
439	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	4-thiazolyl	
440	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	1-pyrazinyl	
441	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-methyl-1-pyrazinyl	
442	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-pyridazinyl	
443	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-methyl-4-pyridazinyl	
444	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	2-furyl	
445	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	3-bromo-2-furyl	
446	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	triazolyl	

【0047】

【表1022】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ⁴			
447	3-thien	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
448	3-thien	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
449	3-thien	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
450	3-thien	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
451	3-thien	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
452	3-furyl	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
453	3-furyl	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
454	3-furyl	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
455	3-furyl	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
456	3-furyl	2-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
457	4-pyraz	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph	
458	4-pyraz	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
459	4-pyraz	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
460	4-pyraz	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
461	4-pyraz	3-CF ₃	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
462	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	Me	Ph-4-OMe	
463	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	Et	Ph-4-OMe	
464	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	nPr	Ph-4-OMe	
465	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	iPr	Ph-4-OMe	
466	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	nBu	Ph-4-OMe	
467	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	tBu	Ph-4-OMe	

【0048】

【表1023】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n. _d
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
468	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-4-OMe	
469	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CHCl	Ph-4-OMe	
470	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-4-OMe	
471	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CH ₂	Ph-4-OMe	
472	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CHCH ₃	Ph-4-OMe	
473	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph-4-OMe	
474	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHF ₂	Ph-4-OMe	
475	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	Ph-4-OMe	
476	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	Ph-4-OMe	
477	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CN	Ph-4-OMe	
478	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ OCH ₃	Ph-4-OMe	
479	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CH	Ph-4-OMe	
480	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CI	Ph-4-OMe	
481	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SMe	Ph-4-OMe	
482	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SOMe	Ph-4-OMe	
483	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SO ₂ Me	Ph-4-OMe	
484	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CO ₂ Me	Ph-4-OMe	
485	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CO ₂ Et	Ph-4-OMe	
486	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Me	Ph-4-OMe	
487	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ NMe ₂	Ph-4-OMe	
488	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ NHMe	Ph-4-OMe	
489	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	Ph-4-OMe	

【0049】

【表1024】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
490	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CONH ₂	Ph-4-OMe	
491	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CUNHMe	Ph-4-OMe	
492	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CONMe ₂	Ph-4-OMe	
493	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CHCF ₃	Ph-4-OMe	
494	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CF ₂	Ph-4-OMe	
495	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C(Br)=CH ₂	Ph-4-OMe	
496	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CCH ₃	Ph-4-OMe	
497	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ C≡CH	Ph-4-OMe	
498	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CCF ₃	Ph-4-OMe	
499	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CF ₃	Ph-4-OMe	
500	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ Cl	Ph-4-OMe	
501	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Br	Ph-4-OMe	
502	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ OEt	Ph-4-OMe	
503	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ OMe	Ph-4-OMe	
504	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ COOH	Ph-4-OMe	
505	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SET	Ph-4-OMe	
506	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SOEt	Ph-4-OMe	
507	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ SO ₂ Et	Ph-4-OMe	
508	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ F	Ph-4-OMe	
509	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHCl ₂	Ph-4-OMe	
510	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CF ₃	Ph-4-OMe	

【0050】

【表1025】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
511	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ OnPr	Ph-4-OMe	
512	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ NHCOCH ₃	Ph-4-OMe	
513	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ NHCOPh	Ph-4-OMe	
514	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CONEt ₂	Ph-4-OMe	
515	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -1-F-cPr	Ph-4-OMe	
516	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-F-cPr	Ph-4-OMe	
517	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-F ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
518	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -1-Cl-cPr	Ph-4-OMe	
519	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-Cl-cPr	Ph-4-OMe	
520	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-Cl ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
521	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -1-Br-cPr	Ph-4-OMe	
522	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-Br-cPr	Ph-4-OMe	
523	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -2-Br ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
524	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -cPent	Ph-4-OMe	
525	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -cHex	Ph-4-OMe	
526	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -cHex-3	Ph-4-OMe	
527	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ -cHex-3, 4-Br ₂	Ph-4-OMe	

【0051】

【表1026】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
528	3-pyrid	2-CF ₃	Me	Ph	
529	3-pyrid	2-CF ₃	Et	2-thienyl	
530	3-pyrid	2-CF ₃	nPr	3-thienyl	
531	3-pyrid	2-CF ₃	iPr	Ph-2,4-F ₂	
532	3-pyrid	2-CF ₃	tBu	Ph-2-F	
533	3-pyrid	2-CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-3-Me-4-OMe	
534	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	3-methyl-pyrazol-1-yl	
535	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	4-methyl-pyrazol-1-yl	
536	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	3-methyl-2-thienyl	
537	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CHF ₂	4-methyl-2-thienyl	
538	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	5-methyl-2-thienyl	
539	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CN	Ph-2-F-3-Me	
540	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ OCH ₃	Ph-2-F-4-OMe	
541	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ C≡CH	Ph-2-F-4-OMe-5-Me	
542	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Ph-2-F-5-Me	
543	3-pyrid	2-CF ₃	CH ₂ C≡Cl	Ph-3-Me-4-F	
544	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	Me	Ph-4-Me	
545	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	Et	Ph-3,5-Me ₂	
546	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	nPr	Ph-2-Cl	
547	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	iPr	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
548	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	tBu	4,6-dimethyl-2-pyrimidinyl	
549	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-4-OCF ₃	

【0052】

【表1027】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
550	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CHCl	Ph	
551	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CCl ₂	2-thienyl	
552	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Cl	3-thienyl	
553	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHF ₂	Ph-2,4-F ₂	
554	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	Ph-2-F	
555	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CN	Ph-3-Me-4-OMe	
556	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ OCH ₃	3-methyl- pyrazol-1-yl	
557	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CH	4-methyl- pyrazol-1-yl	
558	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH=CH ₂	3-methyl- 2-thienyl	
559	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡Cl	4-methyl- 2-thienyl	
560	3-pyrid	4-CF ₃	Me	5-methyl- 2-thienyl	
561	3-pyrid	4-CF ₃	Bt	Ph-2-F-3-Me	
562	3-pyrid	4-CF ₃	nPr	Ph-2-F-4-OMe	
563	3-pyrid	4-CF ₃	iPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
564	3-pyrid	4-CF ₃	tBu	Ph-2-F-5-Me	
565	3-pyrid	4-CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-3-Me-4-F	
566	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Ph-4-Me	
567	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-3,5-Me ₂	
568	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph-2-Cl	
569	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
570	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	4,6-dimethyl- 2-pyrimidinyl	
571	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CN	Ph-4-OCF ₃	

【0053】

【表1028】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ハテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
572	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₃	Ph	
573	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	2-thienyl	
574	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	3-thienyl	
575	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡Cl	Ph-2, 4-F ₂	
576	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	Me	Ph-2-F	
577	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	Et	Ph-3-Me-4-OMe	
578	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	nPr	3-methyl- pyrazol-1-yl	
579	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	iPr	4-methyl- pyrazol-1-yl	
580	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	tBu	3-methyl- 2-thienyl	
581	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	4-methyl- 2-thienyl	
582	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH=CHCl	5-methyl- 2-thienyl	
583	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-2-F-3-Me	
584	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph-2-F-4-OMe	
585	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CHF ₂	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
586	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	Ph-2-F-5-Me	
587	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CN	Ph-3-Me-4-F	
588	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ OCH ₃	Ph-4-Me	
589	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ C≡CH	Ph-3, 5-Me ₂	
590	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH=CH ₂	Ph-2-Cl	
591	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ C≡Cl	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
592	4-pyrid	3-CF ₃	Me	4, 6-dimethyl- 2-pyrimidinyl	
593	4-pyrid	3-CF ₃	Et	Ph-4-OCF ₃	

【0054】

【表1029】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.p.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
594	4-pyrid	3-CF ₃	nPr	Ph	
595	4-pyrid	3-CF ₃	iPr	2-thienyl	
596	4-pyrid	3-CF ₃	tBu	3-thienyl	
597	4-pyrid	3-CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-2,4-F ₂	
598	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Ph-2-F	
599	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-3-Me-4-OMe	
600	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	3-methyl- pyrazol-1-yl	
601	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CHF ₂	4-methyl- pyrazol-1-yl	
602	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	3-methyl- 2-thienyl	
603	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CN	4-methyl- 2-thienyl	
604	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ OCH ₃	5-methyl- 2-thienyl	
605	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ C≡CH	Ph-2-F-3-Me	
606	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Ph-2-F-4-OMe	
607	4-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ C≡Cl	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
608	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	Me	Ph-2-F-5-Me	
609	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	Et	Ph-3-Me-4-F	
610	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	nPr	Ph-4-Me	
611	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	iPr	Ph-3,5-Me ₂	
612	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	tBu	Ph-2-Cl	
613	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-4-OCH ₂ CH=CH ₂	
614	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH=CHCl	4,6-dimethyl- 2-pyrimidinyl	
615	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-4-OCF ₃	

【0055】

【表1030】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
616	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph	
617	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CHF ₂	2-thienyl	
618	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	3-thienyl	
619	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CN	Ph-2,4-F ₂	
620	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ OCH ₃	Ph-2-F	
621	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C≡CH	Ph-3-Me-4-OMe	
622	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH=CH ₂	3-methyl-pyrazol-1-yl	
623	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C≡Cl	4-methyl-pyrazol-1-yl	
624	2-pyrid	3-CF ₃	Me	Ph-4-OMe	
625	2-pyrid	3-CF ₃	Et	Ph-4-OMe	122-123 °C
626	2-pyrid	3-CF ₃	nPr	Ph-4-OMe	
627	2-pyrid	3-CF ₃	iPr	Ph-4-OMe	
628	2-pyrid	3-CF ₃	tBu	Ph-4-OMe	
629	2-pyrid	3-CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-4-OMe	
630	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Ph-4-OMe	
631	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-4-OMe	
632	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph-4-OMe	
633	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Ph-4-OMe	
634	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	Ph-4-OMe	
635	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ CN	Ph-4-OMe	
636	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ OCH ₃	Ph-4-OMe	
637	2-pyrid	3-CF ₃	CH ₂ C≡CH	Ph-4-OMe	

【0056】

【表1031】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m. p. or n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
638	3-pyrid	4-CF ₃	iPr	Ph-4-OMe	
639	3-pyrid	4-CF ₃	nBu	Ph-4-OMe	
640	3-pyrid	4-CF ₃	tBu	Ph-4-OMe	
641	3-pyrid	4-CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Ph-4-OMe	
642	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Ph-4-OMe	
643	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CCl ₂	Ph-4-OMe	
644	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Ph-4-OMe	
645	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CHCH ₃	Ph-4-OMe	
646	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Cl	Ph-4-OMe	
647	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Ph-4-OMe	
648	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C(C1)=CH ₂	Ph-4-OMe	
649	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	Ph-4-OMe	
650	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CN	Ph-4-OMe	
651	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₃	Ph-4-OMe	
652	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	Ph-4-OMe	
653	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡CI	Ph-4-OMe	
654	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SMe	Ph-4-OMe	
655	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SOMe	Ph-4-OMe	
656	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Ph-4-OMe	
657	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CO ₂ Me	Ph-4-OMe	
658	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et	Ph-4-OMe	
659	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Me	Ph-4-OMe	

【0057】

【表1032】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m.p. or n.d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
660	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ NMe ₂	Ph-4-OMe	
661	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ NHMe	Ph-4-OMe	
662	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	Ph-4-OMe	
663	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CONH ₂	Ph-4-OMe	
664	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CONHMe	Ph-4-OMe	
665	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CONMe ₂	Ph-4-OMe	
666	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CHCF ₃	Ph-4-OMe	
667	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH=CF ₂	Ph-4-OMe	
668	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C(Br)=CH ₂	Ph-4-OMe	
669	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡CCH ₃	Ph-4-OMe	
670	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH	Ph-4-OMe	
671	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ C≡CCF ₃	Ph-4-OMe	
672	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Ph-4-OMe	
673	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ Cl	Ph-4-OMe	
674	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ Br	Ph-4-OMe	
675	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ OEt	Ph-4-OMe	
676	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Ph-4-OMe	
677	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ COOH	Ph-4-OMe	
678	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SEt	Ph-4-OMe	
679	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SOEt	Ph-4-OMe	
680	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ SO ₂ Et	Ph-4-OMe	

【0058】

【表1033】

第1表(続き) (r¹, r² = H)

No.	A		R	B	物理恒数 m. p. or n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴			
681	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CH ₂ F	Ph-4-OMe	
682	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CHCl ₂	Ph-4-OMe	
683	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Ph-4-OMe	
684	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ OnPr	Ph-4-OMe	
685	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ NHCOCH ₃	Ph-4-OMe	
686	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ NHCOPh	Ph-4-OMe	
687	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ CONEt ₂	Ph-4-OMe	
688	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -1-F-cPr	Ph-4-OMe	
689	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-F-cPr	Ph-4-OMe	
690	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-F ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
691	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -1-Cl-cPr	Ph-4-OMe	
692	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-Cl-cPr	Ph-4-OMe	
693	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-Cl ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
694	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -1-Br-cPr	Ph-4-OMe	
695	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-Br-cPr	Ph-4-OMe	
696	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -2-Br ₂ -cPr	Ph-4-OMe	
697	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -cPent	Ph-4-OMe	
698	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -cHex	Ph-4-OMe	
699	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -cHex-3	Ph-4-OMe	
700	3-pyrid	4-CF ₃	CH ₂ -cHex-3, 4-Br ₂	Ph-4-OMe	

【0059】

【表1034】

第1表(続き)

No.	A		R	r ¹	r ²	B	物理恒数 m.p.; n _D
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴					
701	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	OMe	H	Ph-2-F-5-Me	
702	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Me	H	Ph	
703	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Et	H	Ph-4-F	
704	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	OMe	CF ₃	Ph-2-F-5-Me	
705	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	F	H	Ph	
706	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Cl	H	Ph-4-OMe	
707	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	SMe	H	Ph-2-F-5-Me	
708	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	Me	Me	Ph	
709	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	F	F	Ph-4-OMe	
710	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	=O		Ph-4-F	
711	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ cPr	NHMe	H	Ph	
712	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CH	OMe	H	Ph-4-OMe	
713	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Ph-4-F	
714	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHF ₂	Et	H	Ph-2-F-5-Me	
715	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CN	OMe	CF ₃	Ph-4-OMe	
716	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CH	F	H	Ph-4-F	
717	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Cl	H	Ph-2-F-5-Me	
718	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHF ₂	SMe	H	Ph	
719	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CN	Me	Me	Ph-4-F	
720	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ C≡CH	F	F	Ph-2-F-5-Me	
721	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CH ₂ Cl	=O		Ph	
722	3-pyrid	2-CF ₃ -4-F	CH ₂ CHF ₂	NHMe	H	Ph-4-OMe	

【0060】

【表1035】

第1表(続き)

No.	A		R	r ¹	r ²	B	物理恒数 m. p. ; n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴					
723	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	OMe	H	Ph-4-F	
724	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Me	H	Ph-2-F-5-Me	
725	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Et	H	Ph-4-OMe	
726	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	OMe	CF ₃	Ph-4-F	
727	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	F	H	Ph-2-F-5-Me	
728	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Cl	H	Ph	
729	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	SMe	H	Ph-4-F	
730	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	Me	Me	Ph-2-F-5-Me	
731	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	F	F	Ph	
732	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	=O		Ph-4-OMe	
733	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ cPr	NHMe	H	Ph-2-F-5-Me	
734	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CHF ₂	OMe	H	Ph	
735	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CN	Me	H	Ph-4-OMe	
736	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ C≡CH	Et	H	Ph-4-F	
737	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH ₂ Cl	OMe	CF ₃	Ph	
738	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CHF ₂	F	H	Ph-4-OMe	
739	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CN	Cl	H	Ph-4-F	
740	3-pyrid	4-CR ₃ -2-F	CH ₂ C≡CH	SMe	H	Ph-2-F-5-Me	
741	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	Me	Ph-4-OMe	
742	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CHF ₂	F	F	Ph-4-F	
743	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ CN	=O		Ph-2-F-5-Me	
744	3-pyrid	4-CF ₃ -2-F	CH ₂ C≡CH	NHMe	H	Ph	

【0061】

【表1036】

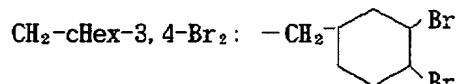
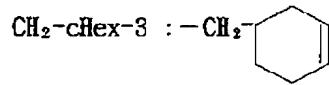
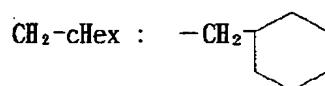
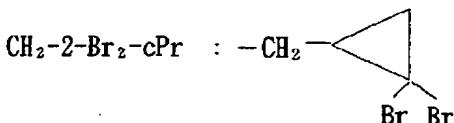
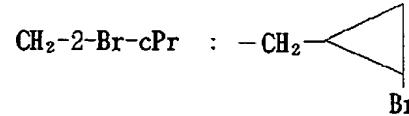
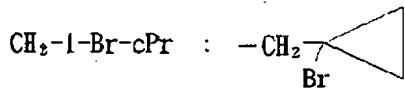
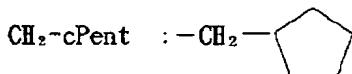
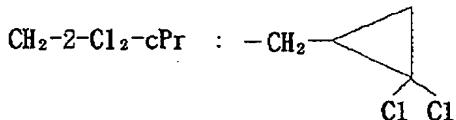
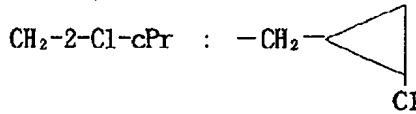
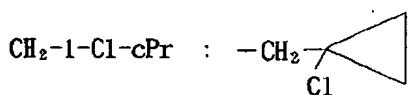
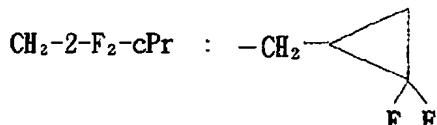
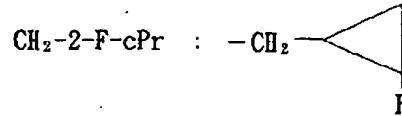
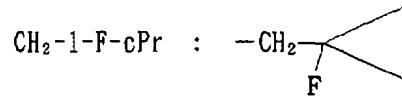
第1表(続き)

No.	A		R	r ¹	r ²	B	物理恒数 m. p. ; n. d.
	ヘテロ環	X ¹ ~ X ¹⁴					
745	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	OMe	H	Ph-4-OMe	
746	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Me	H	Ph-4-F	
747	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Et	H	Ph	
748	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	OMe	CF ₃	Ph-4-OMe	
749	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	F	H	Ph-4-F	
750	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Cl	H	Ph-2-F-5-Me	
751	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	SMe	H	Ph-4-OMe	
752	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Me	Me	Ph-4-F	
753	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	F	F	Ph-2-F-5-Me	
754	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	=O		Ph	
755	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	NHMe	H	Ph-4-F	
756	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C≡CH	OMe	H	Ph-2-F-5-Me	
757	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Ph	
758	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CHF ₂	Et	H	Ph-4-OMe	
759	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CN	OMe	CF ₃	Ph-2-F-5-Me	
760	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C≡CH	F	H	Ph	
761	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH ₂ Cl	Cl	H	Ph-4-OMe	
762	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CHF ₂	SMe	H	Ph-4-F	
763	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CN	Me	Me	Ph	
764	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ C≡CH	F	F	Ph-4-OMe	
765	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CH ₂ Cl	=O		Ph-4-F	
766	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ CHF ₂	NHMe	H	Ph-2-F-5-Me	

【0062】

【表1037】

(注) 表中の略号



【0063】本発明化合物は、広範囲の種類の糸状菌に對し、すぐれた殺菌力をもつてゐることから、花卉、

イネ

いもち病

紋枯病

馬鹿苗病

ごま葉枯病

オオムギ

褐黒穂病

コムギ

赤かび病

赤さび病

眼紋病

ふ枯病

うどんこ病

紅色雪腐病

ジャガイモ

疫病

ラッカセイ

褐斑病

テンサイ

褐斑病

キュウリ

うどんこ病

菌核病

灰色かび病

ベと病

トマト

葉かび病

疫病

芝、牧草を含む農園芸作物の栽培に際し発生する種々の病害の防除に使用することが出来る。例えば、

(Pyricularia oryzae)

(Rhizoctonia solani)

(Gibberella fujikuroi)

(Cochliobolus miyabeanus)

(Ustilago nuda)

(Gibberella zeae)

(Puccinia recondita)

(Pseudocercospora herpotrichoides)

(Leptosphaeria nodorum)

(Erysiphe graminis f. sp. tritici)

(Micronectriella nivalis)

(Phytophthora infestans)

(Mycosphaerella arachidis)

(Cercospora beticola)

(Sphaerotheca fuliginea)

(Sclerotinia sclerotiorum)

(Botrytis cinerea)

(Pseudoperonospora cubensis)

(Cladosporium fulvum)

(Phytophthora infestans)

ナス	黒枯病	(<i>Corynespora melongenae</i>)
タマネギ	灰色腐敗病	(<i>Botrytis allii</i>)
イチゴ	うどんこ病	(<i>Sohaerotheca humuli</i>)
リンゴ	うどんこ病	(<i>Podosphaera leucotricha</i>)
	黒星病	(<i>Venturia inaequalis</i>)
	モニリア病	(<i>Monilinia mali</i>)
カキ	炭そ病	(<i>Gloeosporium kaki</i>)
モモ	灰星病	(<i>Monilinia fructicola</i>)
ブドウ	うどんこ病	(<i>Uncinula necator</i>)
	ベと病	(<i>Plasmopara viticola</i>)
ナシ	赤星病	(<i>Gymnosporangium asiaticum</i>)
	黒斑病	(<i>Alternaria kikuchiana</i>)
チャ	輪斑病	(<i>Pestalotia theae</i>)
	炭そ病	(<i>Colletotrichum theae-sinensis</i>)
カンキツ	そうか病	(<i>Elisinoe fawcetti</i>)
	青かび病	(<i>Pennsillium italicum</i>)
西洋シバ	雪腐大粒菌核病	(<i>Sclerotinia borealis</i>)

などの防除に使用することが出来る。

【0064】また、近年種々の病原菌においてベンツイミダゾール剤やエルゴステロール生合成阻害剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足を生じており、抵抗性系統の病原菌にも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、ベンツイミダゾール剤やエルゴステロール生合成阻害剤抵抗性系統の病原菌にも侵れた殺菌効果を有する薬剤である。適用がより好ましい病害としては、コムギうどんこ病、キュウリうどんこ病、イチゴうどんこ病等の各種うどんこ病が挙げられる。本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接觸物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することも出来る。また、本発明化合物を塗料や繊維などに混入させることで、壁や浴槽、あるいは靴や衣服の防菌、防黴剤として使用することもできる。また本発明化合物の中には、殺虫、殺ダニ活性や除草活性を示すものもある。

【0065】このようにして得られた本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、フロアブル等の形態で使用することもできる。添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ペントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるため

に、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。

【0066】また有効成分量は好ましくは5~70%である。このようにして得られた水和剤、乳剤、フロアブル剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま植物に散布する方法で使用される。なお、本発明化合物は単独でも十分な効力を発揮するが、各種の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤または共力剤の1種類以上と混合して使用することもできる。

【0067】本発明化合物と混合して使用できる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、植物成長調整剤としては以下のようなものが挙げられる。

殺菌剤：

銅剤：塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅等

硫黄剤：チウラム、マンネブ、マンコゼブ、ポリカーバメート、プロピネブ、ジラム、ジネブ等

ポリハロアルキルチオ剤：キャプタン、ジクロルフルアニド、フォルペット等

有機塩素剤：クロロタロニル、フサライド等

有機リン剤：IBP、EDDP、トルクロホスメチル、ピラゾホス、ホセチル等

ベンツイミダゾール剤：チオファネートメチル、ベノミル、カルベンダジム、チアベンダゾール等

ジカルボキシミド剤：イプロジオン、ビンクロゾリン、プロシミドン、フルオルイミド等

カルボキシアミド剤：オキシカルボキシン、メプロニル、フルトラニル、テクロフタラム、トリクラミド、ペンシクロン等

アシリラニン剤：メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル等

SBI剤：トリアジメホン、トリアジメノール、ビテルタノール、ミクロブタニル、ヘキサコナゾール、プロピコナゾール、トリフミゾール、プロクロラズ、ペフラゾート、フェナリモル、ピリフェノックス、トリホリ

ン、フルシラゾール、エタコナゾール、ジクロブトラゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、シプロコナゾール、イマザリル、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、ブチオベート等

抗生物質剤：ポリオキシン、プラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン等

その他：プロパモカルブ塩酸塩、キントゼン、ヒドロキシイソオキサゾール、メタスルホカルブ、アニラジン、イソプロチオラン、プロベナゾール、キノメチオネット、ジチアノン、ジノカブ、ジクロメジン、メパニピリム、フェリムゾン、フルアジナム、ピロキロン、トリシクラゾール、オキソリニック酸、ジチアノン、イミノクタジン酢酸塩、シモキサニル、ピロールニトリル、メタスルホカルブ、ジエトフェンカルブ、ビナパクリル、レシチン、重曹、フェナミノスルフ、ドジン、ジメトモルフ、フェナジンオキシド等

【0068】殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルビリホス、ES P、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスマット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロポキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

ビレスロイド系殺虫剤：ペルメトリル、シペルメトリル、デルタメスリン、フェンバレート、フェンプロパトリル、ピレトリル、アレスリン、テトラメスリン、レ

実施例2 水和剤

本発明化合物

珪藻土

高級アルコール硫酸エステル

アルキルナフタレンスルホン酸塩

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分40%の水和剤を得る。

実施例3 乳剤

本発明化合物

キシレン

ジメチルホルムアミド

スマトリル、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリル、プロトリル、フルバリネット、シフルトリル、シハロトリル、フルシトリネット、エトフェンプロクス、シクロプロトリル、トロラメトリル、シラフルオフェン、ブロフェンプロクス、アクリナスリ等。

【0069】ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトブレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

【0070】殺線虫剤：フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：クロルベンジレート、フェニソブロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネット、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチ、ビリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

植物成長調整剤：ジベレリン類（例えばジベレリンA3、ジベレリンA4、ジベレリンA7）IAA、NA A。

【0071】

【発明の効果】次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。なお、製剤実施例中の部は重量部を示す。

【0072】

【実施例】

〔殺菌剤〕次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

【0073】

40部
53部
4部
3部

【0074】

30部
33部
30部

ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル 7部

以上を混合溶解すれば、有効成分30%の乳剤を得る。 【0075】

実施例4 粉剤

本発明化合物 10部

タルク 89部

ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル 1部

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分10%の粉剤を得る。 【0076】

の粉剤を得る。

実施例5 粒剤

本発明化合物 5部

クレー 73部

ベントナイト 20部

ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩 1部

リン酸ナトリウム 1部

以上をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、 【0077】

造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

実施例6 懸濁剤

本発明化合物 10部

リグニンスルホン酸ナトリウム 4部

ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 1部

キサンタンガム 0.2部

水 84.8部

以上を混合し、粒度が1ミクロン以下になるまで湿式粉碎すれば、有効成分10%の懸濁剤を得る。

【0078】次に、本発明化合物が各種植物病害防除剤の有功成分として有用であることを試験例で示す。防除効果は、調査時の供試植物の状態、すなわち葉や茎等に出現する病斑の程度を肉眼で観察した。

【0079】試験例1 コムギうどんこ病防除試験（予防）

素焼きポットで栽培したコムギ幼苗（品種「チホク」）に本発明化合物の乳剤を有効成分12.5ppmの濃度で十分量散布した。散布後室温で自然乾燥し、コムギうどんこ病菌（*Erysiphe graminiae* f. sp. *tritici*）の分生胞子を振り払い接種し、20°C前後の温室で7日間発病させた。葉上の発斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。その結果、以下の化合物に顕著な防除効果が認められた。

化合物No. 1, 35, 357, 356, 400, 40

2

【0080】試験例2 キュウリうどんこ病防除試験（予防）

素焼きポットで栽培したキュウリ幼苗（品種「相模半白」）に本発明化合物の乳剤を有効成分12.5ppmの濃度で散布した。散布後室温で自然乾燥し、キュウリうどんこ病菌（*Sphaerotheca fuliginea*）の分生胞子を振り払い接種し、25°C前後の恒温室で11日間発病させた。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。その結果、以下の化合物に優れた防除効果が認められた。

化合物No. 400, 402

【0081】以上から、本発明の化合物は、対照薬剤に比してコムギうどんこ病のみならずキュウリうどんこ病に対しても優れた予防効果を有することがわかる。

【表10010】

第1表(続き) $(r^1, r^2 = H)$

No.	A		R	B	物理恒数 m. p. or n. d.
	ヘテロ環	$X^1 \sim X^4$			
199	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph	
200	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-OMe	
201	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2, 4-F ₂	
202	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F	
203	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
204	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me	
205	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-OMe	
206	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-F	
207	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Me	
208	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-3-Me	
209	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe	
210	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-4-OMe -5-Me	
211	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-F-5-Me	
212	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3, 5-Me ₂	
213	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Et	
214	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Me-4-F	
215	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe	
216	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-3-Cl-4-OMe -5-Me	
217	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl	
218	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-4-Br	
219	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-Cl-4-F	
220	4-pyrid	5-CF ₃ -3-F	CH ₂ cPr	Ph-2-Br-4-Me	

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶

識別記号

F 1

A 0 1 N 43/56

A 0 1 N 43/56

A

43/78

43/78

A

C 0 7 D 231/14

C 0 7 D 231/14

A

239/28

239/28

277/30

277/30

307/68

307/68

333/24

333/24

(72)発明者 山中 誉
神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式
会社小田原研究所内